

日 本 国 特 許 庁
JAPAN PATENT OFFICE

28. 6. 2004

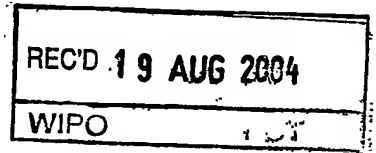
別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出 願 年 月 日 2 0 0 3 年 6 月 2 7 日
Date of Application:

出 願 番 号 特 願 2 0 0 3 - 1 8 4 8 8 1
Application Number:
[ST. 10/C]: [J P 2 0 0 3 - 1 8 4 8 8 1]

出 願 人 湧 永 製 薬 株 式 会 社
Applicant(s):

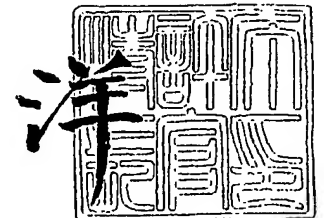


PRIORITY DOCUMENT
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH
RULE 17.1(a) OR (b)

2 0 0 4 年 8 月 5 日

特許庁長官
Commissioner,
Japan Patent Office

小 川



【書類名】 特許願

【整理番号】 PA-JP-450

【あて先】 特許庁長官殿

【発明者】

【住所又は居所】 広島県高田郡甲田町下甲立 1 6 2 4 湧永製薬株式会社
内

【氏名】 池田 陽一

【発明者】

【住所又は居所】 広島県高田郡甲田町下甲立 1 6 2 4 湧永製薬株式会社
内

【氏名】 本畝 聡子

【発明者】

【住所又は居所】 広島県高田郡甲田町下甲立 1 6 2 4 湧永製薬株式会社
内

【氏名】 小野 瑞穂

【発明者】

【住所又は居所】 広島県高田郡甲田町下甲立 1 6 2 4 湧永製薬株式会社
内

【氏名】 毛利 佳史

【特許出願人】

【識別番号】 000250100

【氏名又は名称】 湧永製薬株式会社

【代表者】 草井 由博

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 004385

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 図面 1



| | |
|-----------|-------|
| 【物件名】 | 要約書 1 |
| 【プルーフの要否】 | 要 |

【書類名】 明細書

【発明の名称】 固形剤含有液剤

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 水溶性セルロース誘導体を含む被覆剤で被覆された有効成分が水分含量 10～80%の液剤中に不溶化された状態で存在する液剤。

【請求項 2】 水分含量 10～80%の液剤が 0.50～0.90 の水分活性値を有するものである請求項 1 記載の液剤。

【請求項 3】 水溶性セルロース誘導体がヒドロキシプロピルメチルセルロース、メチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース及びヒドロキシエチルセルロースからなる群から選ばれる 1 種又は 2 種以上のものである請求項 1 又は 2 記載の液剤。

【請求項 4】 液剤が生薬水性エキス及び／又は動植物水性エキスを含むものである請求項 1～3 記載の液剤。

【請求項 5】 有効成分が水に不安定な物質を含むものである請求項 1～4 記載の液剤。

【請求項 6】 請求項 1～5 記載の液剤が充填されたカプセル剤。

【請求項 7】 ーカプセルが硬カプセルである請求項 6 記載のカプセル剤。

【請求項 8】 有効成分を水溶性セルロース誘導体を含む被覆剤で被覆することにより、有効成分を水分含量 10～80%の液剤中で安定化させる方法。

【請求項 9】 水分含量 10～80%の液剤が 0.50～0.90 の水分活性値を有するものである請求項 8 記載の方法。

【請求項 10】 水溶性セルロース誘導体がヒドロキシプロピルメチルセルロース、メチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース及びヒドロキシエチルセルロースからなる群から選ばれる 1 種又は 2 種以上のものである請求項 8 又は 9 記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は、医薬品、医薬部外品、化粧品、食品等に使用される液剤に関し、更

に詳細には、水溶性セルロース誘導体を含む被覆剤にて被覆された有効成分を含む有する液剤に関する。また液剤中の有効成分の安定化方法に関する。

【0002】

【従来の技術】

従来、液剤は医療・食品分野において服用時のコンプライアンスを上げ、吸収が早い剤形として使用されている。

【0003】

内服液剤は、通常、生薬類、水溶性薬物等を有効成分として、また矯味剤、着色剤、着香剤等の水溶性添加物を水に溶解して、調製する。一般的に、糖濃度が高濃度の濃稠なものはシロップ剤に分類され、低濃度のものは、いわゆるドリンク剤等の内服液剤に分類される。しかしいずれの場合も、約30%～90%程度の水分を含んでおり、水に不安定な成分では保存安定性を確保できないものがある。また水溶液中に溶解している成分は分子状態で分散しており、他の成分分子の影響を受けて変化し、液剤の品質低下の原因となっている。さらに、液剤の場合、性状的に苦み、辛みを持つ成分は、固形剤に比べ、より性状を強く感じるため、これらの成分を液剤にするには、多くの添加剤が必要になったり、服用には適さないため液剤化が不可能なこともある。

【0004】

水に不安定な成分や、不快な風味を持つ成分を液剤に添加するには、例えば、生薬エキス含有液剤のpHを2.2～3.8に調整して安定化を図る技術（例えば、特許文献1参照）やイオン強度を調整したり、シクロデキストリンを安定化剤としてビタミンB1含有液剤に配合する技術（例えば、特許文献2参照）が知られている。また、有効成分をW/O/Wエマルジョンとし、安定性を確保する方法（例えば、非特許文献1参照）も検討されているが、液剤としての物理化学的安定性や調製条件が非常に煩雑であるなどの問題がある。

【0005】

一方、水溶性セルロース誘導体は、コーティング剤や結合剤として用いられているが、高温下にて水に不溶なゲルを形成するため、缶入りスープ中の添加物で加熱殺菌中に変化又は消失する性質を有する香料等を保護し、冷却後はその被覆

が溶解する技術（例えば、特許文献3参照）、あるいは可食性の水溶性添加物または可食性の高分子物質とともに香料を被覆してコーティング粉末とし、加熱調理食品、焼き菓子等の製造中の加熱処理に対して、香料の消失を保護する技術（例えば、特許文献4参照）が知られている。

【0006】

しかしながら、これらの技術では、有効成分の安定性や不快な味を解消するには十分でなかった。従って、有効成分の安定性、特に水分が存在する状態における長期間の保存安定性に優れ、かつ不快な味や臭い等をマスキングすることができ、さらには、服用後に消化管内で速やかに吸収可能な液剤の開発が望まれていた。

【0007】**【特許文献1】**

特開 2000-38345号公報 （特許請求の範囲）

【特許文献2】

特開 2003-146880号公報 （特許請求の範囲）

【特許文献3】

米国特許第 6056992号明細書 （特許請求の範囲）

【特許文献4】


特開 2002-320454号公報 （特許請求の範囲）

【非特許文献1】

M. Gallarate、他3名、「On the stability of ascorbic acid in emulsified systems for topical and cosmetic use」International Journal of Pharmaceutics、(1999)、188、p. 233-241

【0008】**【発明が解決しようとする課題】**

本発明は、液剤中における有効成分の保存安定性の改善を目的とする液剤組成物を提供することをその目的とする。また水溶液中における有効成分の安定化方



法を提供することをその目的とする。

【0009】

【課題を解決するための手段】

本発明者らは、斯かる事情に鑑み、有効成分を被覆し固形剤として、水溶液との接触を抑制させる方法について鋭意研究を重ねた結果、水溶性セルロース誘導体で被覆された有効成分が特定の水分含量の液剤中で溶けることなく安定に保持できることを見出し、さらに該液剤をカプセル剤として調製可能であることを見出した。また有効成分を水溶性セルロース誘導体で被覆することにより、有効成分を特定の水分含量の液剤中で安定化させる方法を見出し、本発明を完成するに至った。

【0010】

すなわち本発明は、水溶性セルロース誘導体を含む被覆剤で被覆された有効成分が水分含量 1 0 ～ 8 0 % の液剤中に不溶化された状態で存在する液剤を提供するものである。

【0011】

また本発明は、該液剤が充填されたカプセル剤を提供するものである。

【0012】

更に本発明は、有効成分を水溶性セルロース誘導体を含む被覆剤で被覆することにより、有効成分を水分含量 1 0 ～ 8 0 % の液剤中で安定化させる方法を提供するものである。

【0013】

【発明の実施の形態】

本発明における有効成分は特に限定されるものではなく、例えば薬物、天然物、食品、生薬エキス、発酵物等の任意の化合物又は組成物のいずれか 1 種又は 2 種以上を含有するものである。好ましくは、有効成分が水に不安定な物質や他の成分と相互作用を起こす物質あるいは苦味、辛味、渋み等の不快な味や不快な臭いを有する物質を含有するものである。更に好ましくは、有効成分が水に不安定な物質を含むものである。

【0014】

有効成分の具体例としては、ビタミンB1類、ビタミンB2類、ナイアシン、ビタミンB6類、ビタミンB12類、ビタミンC類、ビタミンE類、パントテン酸、ビオチン、葉酸類、パントテニールアルコール等のビタミン類、薬用ニンジン、ニンニク、カンゾウ、シャクヤク、イカリソウ等の生薬類、ブルーベリー、緑茶、胡椒、唐辛子、薄荷等のハーブ類、アスピリン、プロカイン、アミノ安息香酸エチル、アトロピン等のカルボン酸エステル類、ペニシリン類、セファロスポリン類、スルフィド類等が挙げられるが、好ましくは水に不安定なビタミンB1類、ビタミンE類、ビタミンB12類、ビタミンC類、アスピリン、スルピリン、プロカイン、クロラムフェニコール、スルピリン、ベンジルペニシリン、ニトロフラントイン、シトラビン等である。また有効成分が他の成分と相互作用起こすものについては、相互作用を起こす成分のどちらか、又はそれぞれを別々に被覆することができる。

【0015】

また、上記有効成分とともに、必要に応じて他の成分、例えば食品、医薬品に一般的に用いることができる甘味剤、酸味剤、安定化剤、着色剤、着香剤等を用いることができる。

【0016】

本発明において、有効成分を被覆する水溶性セルロース誘導体としては、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、メチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース等の胃溶性セルロース誘導体、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセテートサクシネート、カルメロース、カルボキシメチルエチルセルロース、酢酸フタル酸セルロース、エチルセルロース等の腸溶性セルロース誘導体が挙げられ、これらのいずれか1種又は2種以上組み合わせて用いることができるが、好ましくはヒドロキシプロピルメチルセルロース、メチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース及びヒドロキシエチルセルロースである。本発明における被覆剤は、これらの水溶性セルロース誘導体を水、アルコール又は含水アルコール等に溶解して調製することができる。

【0017】

水溶性セルロース誘導体の添加量は、有効成分に対して、8～30重量%であり、被覆剤には、製剤技術において一般的に用いられる添加剤、例えば可塑剤、着色剤、ゲル化剤、ゲル化補助剤、乳化剤、分散剤、保存剤等を加えることができる。

【0018】

可塑剤としてポリビニルアセタールジエチルアミノアセテート、クエン酸トリエチル、トリアセチン、グリセリン、D-ソルビトール、ポリエチレングリコール、アセチル化モノグリセライドや界面活性剤が挙げられ、これらのいずれか1種又は2種以上を組み合わせる用いることができるが、好ましくはクエン酸トリエチルである。

【0019】

着色剤としては、カラメル、銅クロロフィリンナトリウム、リン酸リボフラビンナトリウム、インジゴカルミン、ブリリアントブルー、タートラジン、サンセットイエロー、ニューコクシン、アマランス、エリスロシン、酸化チタン、酸化鉄等が挙げられ、これらのいずれか1種又は2種以上を組み合わせる用いることができる。

【0020】

ゲル化剤としては、カラギーナン、キサンタンガム、ローカストビーンガム、ジェランガム、アラビアガム、グァーガム、タマリンド種子多糖、ペクチン、カードラン、ゼラチン、ファーセララン、寒天等が挙げられ、これらのいずれか1種又は2種以上を組み合わせる用いることができるが、好ましくはカラギーナンである。また、ゲル化剤の添加量は、被覆剤の水溶液に対して、0.1～5.0重量%が好ましい。

【0021】

ゲル化補助剤としては、塩化カルシウム、塩化カリウム、塩化アンモニウム、酢酸アンモニウム、リン酸カリウム、クエン酸カリウム、塩化ナトリウム、硫酸マグネシウム等のカルシウムイオン、カリウムイオン、アンモニウムイオン、ナトリウムイオン、またはマグネシウムイオンを与える水溶性化合物、クエン酸又はクエン酸ナトリウム等の有機酸及びその水溶性塩が挙げられ、これらのいずれ

か1種又は2種以上を組み合わせる用いることができる。なお、ゲル化補助剤の添加量は、被覆剤の水溶液に対して、0.01～1.0重量%が好ましい。

【0022】

有効成分を被覆剤にて被覆した固形剤は、錠剤、顆粒、粉末等が挙げられるが、好ましくは分散性のよい粉末である。

【0023】

液剤は、医薬品、医薬部外品、化粧品、食品等のいずれか1種又は2種以上を含むものであり、例えば、薬用ニンジン、ニンニク、エゾウコギ、トウキ、ジオウ、チンピ、トシシ、ゴミシ、バクモンドウ等の生薬水性エキス剤、葛根湯、麦門冬湯、小青龍湯、黄連解毒湯、四物湯、芍薬甘草湯等の漢方水性エキス剤、ブルーベリー、緑茶、ハーブ類、キノコ類、マムシ等の動植物の水性エキス、穀物、植物、海産物を麹菌、紅麹菌、乳酸菌、酢酸菌、納豆菌、酵母等で発酵させた発酵物の水性エキス、ビタミン類、臭化水素酸デキストロメトルファン、アセトアミノフェン、マレイン酸クロルフェニラミン、グアヤコールスルホン酸カリウム、カフェイン、リン酸ジヒドロコデイン、塩酸メチルエフェドリン、水溶性アズレン等の水溶液、アルジオキサ、水酸化マグネシウム、スクラルファート、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、合成ヒドロタルサイト等の懸濁水溶液等が挙げられる。なお、ここでいう水性エキスには、生薬、動植物、発酵物等を水又は含水アルコール等で抽出した抽出物であって、好ましくは、水溶液として安定に存在し、液体のまま製剤化可能な生薬水性エキスや動植物水性エキスである。

【0024】

また上記液剤には、必要に応じて他の成分、例えば医薬品、食品に一般的に用いることができる甘味剤、酸味剤、安定化剤、増粘剤、pH調整剤、防腐剤、着色剤、着香剤等を用いることができる。

【0025】

ここで甘味剤としては、ショ糖、乳糖、果糖、ブドウ糖等の糖類もしくはソルビトール、エリスリトール、マンニトール、キシリトール、トレハロース等の糖アルコール若しくはグリチルリチン、アスパルテーム、ステビア等が挙げられ、これらのいずれか1種又は2種類以上を組み合わせる用いることができる。

【0026】

酸味剤としては、クエン酸、リンゴ酸、コハク酸、フマル酸、酒石酸、乳酸等が挙げられ、これらのいずれか1種又は2種類以上を組み合わせる用いることができる。

【0027】

安定化剤としては、アスコルビン酸、エリソルビン酸、ピロ亜硫酸ナトリウム等の抗酸化剤、ピロリン酸ナトリウム、ポリリン酸ナトリウム、メタリン酸ナトリウム等の分散剤、ショ糖脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレングリコール等の界面活性剤類、シクロデキストリン、グルコシルシクロデキストリン、マルトシルシクロデキストリン、ヒドロキシプロピルシクロデキストリン等のシクロデキストリン類、塩化ナトリウム、塩化マグネシウム、塩化カルシウム等の電解質類が挙げられ、これらのいずれか1種又は2種類以上を組み合わせる用いることができる。

【0028】

増粘剤としては、デキストリン、アルギン酸ナトリウム、アルギン酸プロピレングリコールエステル、トラガント末、キサントガム、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン等の高分子が挙げられ、これらのいずれか1種又は2種類以上を組み合わせる使用することができる。

【0029】

pH調整剤としては、塩酸、酢酸、リン酸、クエン酸、リンゴ酸、コハク酸、フマル酸、酒石酸、乳酸等の無機酸及び有機酸又はこれらの塩や、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸水素ナトリウム、リン酸二水素ナトリウム等のアルカリが挙げられ、これらのいずれか1種又は2種以上を組み合わせる用いることができる。

【0030】

防腐剤としては、安息香酸類、ソルビン酸類、パラオキシ安息香酸エステル類、サリチル酸類が挙げられ、これらのいずれか1種又は2種以上を組み合わせる使用することができる。

【0031】

着色剤としては、カラメル、銅クロロフィリンナトリウム、リン酸リボフラビンナトリウム、インジゴカルミン、ブリリアントブルー、タートラジン、サンセットイエロー、ニューコクシン、アマランス、エリスロシン等が挙げられ、これらのいずれか1種又は2種以上を組み合わせ使用することができる。

【0032】

着香剤としては、ウイキョウ油、オレンジ油、ケイヒ油、トウヒ油、ハッカ油、バニリン、ユーカリ油等が挙げられ、これらの1種又は2種以上を原料として調製された天然香料や調合香料を用いることもできる。

【0033】

以上示した液剤は、水分含量が10～80％に調整されたものであるが、好ましくは、水分含量が10～30％に調整されたものである。

【0034】

液剤の水分含量が80％を超えた場合、被覆を溶解させるに十分な水が存在することとなり、好ましくない。一方、水分含量が10％を下回るものは粘度が著しく上昇し、液性としての流動性を持たないため、服用が困難となり、好ましくない。

【0035】

本発明の液剤は、さらに水分活性値を0.50～0.90に調整することにより流動性の高い液剤を得ることができる。

【0036】

本発明における有効成分の被覆方法としては、一般的なコーティング方法でよく、例えばスプレードライ、流動層コーティング法、遠心力コーティング法等を用いることができる。また被覆剤をカプセル形状とし、有効成分をカプセル内に充填してもよい。有効成分が充填されたカプセル剤は、有効成分が被覆された固形剤と同様、液剤の調製中に加えることができる。

【0037】

液剤は、更に適量をカプセルに充填しカプセル剤とすることもできる。この場合には、有効成分を被覆した固形剤は、予め液剤に混合された状態でもよく、カ

プセルに充填された状態でもよい。カプセル剤は、水溶性成分を充填可能な軟カプセル剤や硬カプセル剤として調製することができるが、好ましくは水溶性セルロース誘導体を含む硬カプセル剤である。

【0038】

液剤の包装形態は、一般的に用いられている形態、例えば、ビン充填、アルミ分包等が挙げられるが、特にビン充填が好ましい。またカプセル剤は、従来用いられている油状物質用の液状薬物充填機、顆粒充填機を用いて調製することができる。

【0039】

本発明の液剤の好ましい態様としては、例えば、ビタミン類をヒドロキシプロピルメチルセルロースを含む被覆剤にて被覆して顆粒又は粉末とし、これらを生薬エキスを含有水分含量 10～40% の液剤に添加したものであり、ビン充填されたものが好ましい。

【0040】**【実施例】**

以下、実施例により本発明を更に詳細に説明するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

【0041】**実施例 1**

| | |
|--------------|--------|
| 塩酸チアミン | 1000 g |
| アビセル | 1925 g |
| 乳糖 | 1300 g |
| L-HPC | 650 g |
| HPC-SL | 100 g |
| ステアリン酸マグネシウム | 25 g |

上記の処方により直径 6 mm の錠剤を製し、ヒドロキシプロピルメチルセルロース 8% 水溶液を噴霧乾燥し、錠剤全量の 8% に相当する量を被覆させた。本被覆錠を水分含量 31% の生薬エキスを添加し、ガラスビンに充填した後、密栓し

、40℃で1カ月間保存した。錠剤中の塩酸チアミン含量をHPLCで測定した結果、対初期値101.1%であり、低下は全く認められなかった。また被覆は溶解しておらず、液剤の性状に変化は認められなかった。

【0042】

実施例 2

実施例1の処方の錠剤にヒドロキシプロピルメチルセルロース5.6%およびポリビニルアセタールジエチルアミノアセテート2.4%水溶液を噴霧乾燥し、錠剤全量の8%に相当する量を被覆させた。本被覆錠を水分含量31%の生薬エキスを添加し、ガラスビンに充填した後、密栓し、40℃で1カ月間保存した。錠剤中の塩酸チアミン含量をHPLCで測定した結果、対初期値100.0%であり、低下は全く認められなかった。また、被覆は溶解しておらず、液剤の性状に変化は認められなかった。

【0043】

実施例 3

| | |
|--------|------|
| 塩酸チアミン | 150g |
| アビセル | 600g |
| 乳糖 | 495g |
| L-HPC | 225g |
| HPC-SL | 30g |

上記の処方により混合・練合して、押出し造粒した直径1.2mmの顆粒に、10%エタノールに溶解したヒドロキシプロピルメチルセルロース5%液を噴霧乾燥し、顆粒7.5%に相当する量を被覆させた。本被覆顆粒を水分含量31%の生薬エキスを添加し、ガラスビンに充填した後、密栓し、40℃で3カ月間保存した。顆粒中の塩酸チアミン含量をHPLCで測定した結果、対初期値83.7%であった。また、被覆は溶解しておらず、液剤の性状に変化は認められなかった。

【0044】

実施例 4

| | |
|--------|-------|
| 塩酸チアミン | 300 g |
| アビセル | 585 g |
| 乳糖 | 390 g |
| L-HPC | 195 g |
| HPC-SL | 30 g |

上記の処方により混合・練合して、押出し造粒した直径0.5 mmの顆粒に、10%エタノールに溶解したヒドロキシプロピルメチルセルロース8%とクエン酸トリエチル1%液を噴霧乾燥し、顆粒30%に相当する量を被覆させ被覆顆粒を得た。被覆顆粒を水分含量31%の生薬エキスを添加し、ガラスビンに充填した後、密栓し、40℃で3カ月間保存した。顆粒中の塩酸チアミン含量をHPLCで測定した結果、対初期値81.5%であった。また、被覆剤は溶解しておらず、液剤の性状に変化は認められなかった。

【0045】

実施例 5

塩酸チアミンをヒドロキシプロピルメチルセルロース製2号カプセルに充填し、接合部をヒドロキシプロピルメチルセルロース50%エタノール溶液でシールした後、水分含量30%の生薬エキスを浸漬させ、ガラスビンに充填した後、密栓し、40℃で3カ月間保存した。カプセル中の塩酸チアミン含量をHPLCで測定した結果、対初期値98.7%であった。また、カプセル剤は溶解しておらず、液剤の性状に変化は認められなかった。

【0046】

比較例 1

実施例1の処方の素錠を水分含量31%の生薬エキスを添加し、ガラスビンに充填した後、密栓し、40℃で1カ月間保存した。液剤中の塩酸チアミン含量をHPLCで測定した結果、対初期値64.9%であった。このとき、錠剤は崩壊し、形状を維持していなかった。

【0047】

比較例 2

実施例 3 の処方で調製した直径 0.5 mm の素顆粒を水分含量 31 % の生薬エキスを添加し、ガラスビンに充填した後、密栓し、40℃で3カ月間保存した。液剤中の塩酸チアミン含量を HPLC で測定した結果、対初期値 38.4 % であった。このとき、顆粒は崩壊し、微粒子となって分散していた。

【0048】

実施例 6

水分含量 10 ~ 80 % の液剤中において溶解を抑制された、水溶性セルロース誘導体で被覆した固形剤の水溶液中における溶解性を確認した。実施例 1、2、3、4、5 にて調製した被覆剤および比較例 1、2 で調製した固形剤を、溶媒を水、温度 37℃ の条件下、溶出試験を行った。その結果、図 1 に示すように被覆した固形剤は、ラグタイムを持つものの 15 分以内に全て溶解した。

このことにより、本発明の固形剤は、摂取時には速やかに溶解することが判明した。

【0049】

【発明の効果】

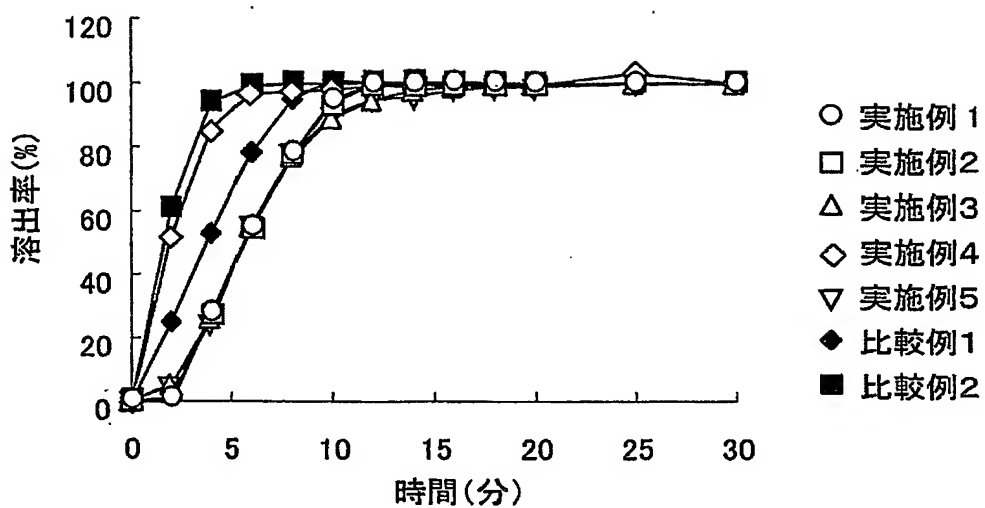
本発明によれば、有効成分を水溶性セルロース誘導体を含む被覆剤にて被覆した固形剤を、特定の液剤に添加したとき、被覆が溶解せず、有効成分の安定性や苦味などの服用感を損なうことのない液剤を提供することができ、更に服用後、消化管内において被覆は速やかに溶解する。また本発明の液剤は、カプセルに充填することも可能であり、さらにコンプライアンスを上げることができる。

【図面の簡単な説明】

【図 1】 実施例および比較例にて調製した液剤中の固形剤の溶出率を示した図である。

【書類名】 図面

【図 1】



【書類名】 要約書

【要約】

【解決手段】 ヒドロキシプロピルメチルセルロース等の水溶性セルロース誘導体を含む被覆剤を用いて、有効成分に被覆を施した固形剤を調製し、水分含量を調整した液剤中において不溶化された状態で存在する液剤を提供する。

【効果】 水に不安定、または相互作用をおこす有効成分を水分含量が高い液剤に添加することが可能であり、有効成分の安定性や服用感を損なうことのない液剤に利用できる。本液剤は医薬品、医薬部外品、化粧品、食品等に利用できる。

【選択図】 なし

認定・付加情報

| | |
|---------|--------------------------|
| 特許出願の番号 | 特願 2 0 0 3 - 1 8 4 8 8 1 |
| 受付番号 | 5 0 3 0 1 0 7 8 1 1 3 |
| 書類名 | 特許願 |
| 担当官 | 第六担当上席 0 0 9 5 |
| 作成日 | 平成 1 5 年 6 月 3 0 日 |

< 認定情報・付加情報 >

【提出日】 平成 15 年 6 月 27 日

特願 2 0 0 3 - 1 8 4 8 8 1

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号 [0 0 0 2 5 0 1 0 0]

1. 変更年月日 1 9 9 4 年 1 0 月 1 1 日

[変更理由] 住所変更

住 所 大阪府大阪市淀川区宮原 4 丁目 5 番 3 6 号

氏 名 湧永製薬株式会社